

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

| | | | |
|--|--|--|------------------|
| Applicant's or agent's file reference PCT-A0514-00 | FOR FURTHER ACTION | | See item 4 below |
| International application No. PCT/JP2005/004825 | International filing date (<i>day/month/year</i>) 17 March 2005 (17.03.2005) | Priority date (<i>day/month/year</i>) 24 March 2004 (24.03.2004) | |
| International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237 | | | |
| Applicant KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD. | | | |

| | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
|-------------------------------------|---|---|-----------|---------------------|--------------------------|------------|----------|-------------------------------------|-------------|--|--------------------------|------------|----------------------------|-------------------------------------|-----------|---|--------------------------|------------|-------------------------|--------------------------|-------------|--|--------------------------|--------------|---|
| 1. | This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a). | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 2. | <p>This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.</p> <p>In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.</p> | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 3. | <p>This report contains indications relating to the following items:</p> <table style="width: 100%; border: none;"> <tr> <td style="width: 10%; text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td style="width: 30%;">Box No. I</td> <td style="width: 60%;">Basis of the report</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. II</td> <td>Priority</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. III</td> <td>Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. IV</td> <td>Lack of unity of invention</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. V</td> <td>Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VI</td> <td>Certain documents cited</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VII</td> <td>Certain defects in the international application</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VIII</td> <td>Certain observations on the international application</td> </tr> </table> | <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. I | Basis of the report | <input type="checkbox"/> | Box No. II | Priority | <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. III | Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability | <input type="checkbox"/> | Box No. IV | Lack of unity of invention | <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. V | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement | <input type="checkbox"/> | Box No. VI | Certain documents cited | <input type="checkbox"/> | Box No. VII | Certain defects in the international application | <input type="checkbox"/> | Box No. VIII | Certain observations on the international application |
| <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. I | Basis of the report | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> | Box No. II | Priority | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. III | Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> | Box No. IV | Lack of unity of invention | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. V | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VI | Certain documents cited | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VII | Certain defects in the international application | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII | Certain observations on the international application | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4. | The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2). | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |

| | | | | |
|---|---|--|--|-----------------------|
| The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 82 70 | <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <tr> <td style="padding: 2px;">Date of issuance of this report 26 September 2006 (26.09.2006)</td> </tr> <tr> <td style="padding: 2px;"> Authorized officer <div style="text-align: center; font-weight: bold; font-size: 1.2em;">Yoshiko Kuwahara</div> </td> </tr> <tr> <td style="padding: 2px;">e-mail: pt07@wipo.int</td> </tr> </table> | Date of issuance of this report 26 September 2006 (26.09.2006) | Authorized officer <div style="text-align: center; font-weight: bold; font-size: 1.2em;">Yoshiko Kuwahara</div> | e-mail: pt07@wipo.int |
| Date of issuance of this report 26 September 2006 (26.09.2006) | | | | |
| Authorized officer <div style="text-align: center; font-weight: bold; font-size: 1.2em;">Yoshiko Kuwahara</div> | | | | |
| e-mail: pt07@wipo.int | | | | |

特許協力条約

発行人 日本国特許庁 (国際調査機関)

REC'D 28 APR 2005

WIPO

PCT

代理人

キッセイ薬品工業株式会社 知的財産部

様

あて名

〒399-8710

日本国長野県松本市芳野19番48号

PCT

国際調査機関の見解書
(法施行規則第40条の2)
[PCT規則43の2.1]

発送日
(日.月.年)

26.4.2005

出願人又は代理人

の書類記号 PCT-A0514-00

今後の手続きについては、下記2を参照すること。

国際出願番号

PCT/J P 2005/004825

国際出願日

(日.月.年) 17.03.2005

優先日

(日.月.年) 24.03.2004

国際特許分類 (IPC) Int.Cl.⁷ A61K31/137, 31/18, 31/505, 45/00, A61P13/00

出願人 (氏名又は名称)

キッセイ薬品工業株式会社

1. この見解書は次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 見解の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

2. 今後の手続き

国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国際予備審査機関がPCT規66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書を国際予備審査機関の見解書とみなさない旨を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。

この見解書が上記のように国際予備審査機関の見解書とみなされる場合、様式PCT/ISA/220を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。

さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。

3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。

見解書を作成した日

06.04.2005

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

伊藤 幸司

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

4C

9450

様式PCT/ISA/237 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 見解の基礎

1. この見解書は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の官語を基礎として作成された。

☐ この見解書は、 語による翻訳文を基礎として作成した。
それは国際調査のために提出された PCT 規則 12.3 及び 23.1(b) にいう翻訳文の官語である。

2. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、以下に基づき見解書を作成した。

- a. タイプ ☐ 配列表
☐ 配列表に関連するテーブル
- b. フォーマット ☐ 書面
☐ コンピュータ読み取り可能な形式
- c. 提出時期 ☐ 出願時の国際出願に含まれる
☐ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された
☐ 出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された

3. ☐ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

4. 補足意見：

第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 11

理由：

☒ この国際出願又は請求の範囲 11 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 11 は、治療による人体の処置方法に関するものであって、PCT 第 34 条 (4) (a) (i) 及び PCT 規則 67.1 (iv) の規定により、国際予備審査機関が国際予備審査を行うことを要しない対象に係るものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 _____ の記載が不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 _____ が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 11 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書 C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

☐ 提出されていない。

☐ 所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐ 提出されていない。

☐ 所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書 C の 2 に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

| | | | |
|----------------|-------|------|---|
| 新規性 (N) | 請求の範囲 | 1-10 | 有 |
| | 請求の範囲 | | 無 |
| 進歩性 (IS) | 請求の範囲 | | 有 |
| | 請求の範囲 | 1-10 | 無 |
| 産業上の利用可能性 (IA) | 請求の範囲 | 1-10 | 有 |
| | 請求の範囲 | | 無 |

2. 文献及び説明

文献1: WO 2003/024916 A1 (キッセイ薬品工業株式会社) 2003.03.27
 文献2: WO 02/069906 A2 (CELL-EGY PHARMACEUTICALS, INC.) 2002.09.12
 文献3: WO 00/02846 A1 (キッセイ薬品工業株式会社) 2000.01.20
 文献4: JP 2001-288115 A (山之内製薬株式会社) 2001.10.16
 文献5: JP 2003-55261 A (ファイザー・プロダクツ・インク) 2003.02.26
 文献6: JP 2001-114679 A (山之内製薬株式会社) 2001.04.24

<請求の範囲1-10>

請求の範囲1-10に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1-6より、進歩性を有しない。

文献1には、 α -アドレナリン受容体アンタゴニスト(プラゾシン、テラゾシン等)と β -アドレナリン受容体アゴニストとを組み合わせた(組織内)膀胱炎治療薬が記載されている(特に、第[06]段落、第[31]段落、第[32]段落、第[45]段落、第[46]段落)。また、同文献には、第[06]段落に、治療対象とする膀胱炎の症状として頻尿が具体的に挙げられていること、本願明細書第[0023]段落においても、「…慢性または急性膀胱炎、慢性または急性前立腺炎等に伴う頻尿や尿失禁の予防または治療に対して…」と記載されていること、及び膀胱炎と頻尿、尿失禁とに関連性があることは広く認識されていることが技術常識であることを勘案するに、文献1に記載された発明と請求の範囲1-10に係る発明とは治療対象疾患として何等相違するものとは認められない。

一方、文献2及び3には、それぞれ式(I)で表されるフェノキシ酢酸誘導体が β -アドレナリン受容体刺激作用を有し、頻尿、尿失禁等の疾患の予防/治療に有用であることが記載されており、且つ文献2には、第4頁第33行-第5頁第9行に該フェノキシ酢酸誘導体を α 1-アドレナリン受容体アンタゴニストとともに併用することが示唆されているのであるから、文献1に記載された発明において、頻尿、尿失禁を含めた膀胱炎等泌尿生殖器疾患の治療薬の一成分である β -アドレナリン受容体アゴニストとして、文献2及び3に記載のフェノキシ酢酸誘導体を採用し採用して試みることは当業者が容易になし得ることである。また、文献4-6には、泌尿生殖器疾患治療に有用な α -アドレナリン受容体アンタゴニストとしてタムスロシン、ナフトピジ

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V.2 欄の続き

ル等が記載されているのであるから、文献1に記載された発明において、泌尿生殖器疾患の治療薬の一成分である α -アドレナリン受容体アンタゴニストとして文献4-6に記載のタムスロシン、ナフトピジル等を採用してみることは当業者が適宜想到し得ることである。

そして、本願明細書には、 $\alpha 1$ -アドレナリン受容体遮断薬として塩酸タムスロシン又はシロドシンを選択し、これらと式(I)で表されるフェノキシ酢酸誘導体とを組み合わせた場合に膀胱内圧低下作用、排尿間隔延長作用を有することが開示されているに過ぎず、他の代表的な $\alpha 1$ -アドレナリン受容体遮断薬を選択する場合にも同等の作用を有するのか確認することができない。また、本願明細書の記載からでは、かかる膀胱内圧低下作用、排尿間隔延長作用が、2成分を組み合わせたことによる単なる相加効果に過ぎないのか又は相乗効果に相当するものであるのかも確認することができない。してみれば、請求の範囲1-10に係る発明の効果が、文献1-6に記載された発明から当業者にとって予測困難な格別顕著なものであるとは認められない。